

P021046

6x40p

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES  
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
16. Oktober 2003 (16.10.2003)

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
WO 03/084533 A1

PCT

(51) Internationale Patentklassifikation<sup>7</sup>: A61K 31/402,  
31/451, C07D 207/22, 211/72, 401/12, 453/06

GLEITZ, Johannes [DE/DE]; Liebigstrasse 26, 64293  
Darmstadt (DE).

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP03/02349

(74) Gemeinsamer Vertreter: MERCK PATENT GMBH;  
Frankfurter Strasse 250, 64293 Darmstadt (DE).

(22) Internationales Anmeldedatum:  
7. März 2003 (07.03.2003)

(81) Bestimmungsstaaten (national): AE, AG, AL, AM, AT,  
AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR,  
CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE,  
GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR,  
KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK,  
MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU,  
SD, SE, SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG,  
US, UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(84) Bestimmungsstaaten (regional): ARIPO-Patent (GH,  
GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW),  
eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ,  
TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE,  
DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL,  
PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG,  
CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

Veröffentlicht:  
— mit internationalem Recherchenbericht

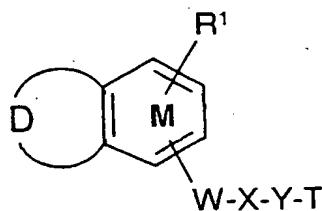
(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von  
US): MERCK PATENT GMBH [DE/DE]; Frankfurter  
Strasse 250, 64293 Darmstadt (DE).

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Ab-  
kürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Co-  
des and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der  
PCT-Gazette verwiesen.

(72) Erfinder; und  
(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): CEZANNE, Bertram  
[DE/DE]; Bahnstrasse 74, 64546 Mörfelden-Walldorf  
(DE). DORSCH, Dieter [DE/DE]; Königberger Strasse  
17A, 64372 Ober-Ramstadt (DE). MEDERSKI, Werner  
[DE/DE]; Katzenelnbogenweg 1, 64673 Zwingenberg  
(DE). TSAKAKIDIS, Christos [GR/DE]; Im Langen-  
wann 54, 69469 Weinheim (DE). BARNES, Christopher  
[GB/DE]; Alleestrasse 1, 65812 Bad Soden (DE).

(54) Title: N-'4-(2-IMINO-PYRROLIDIN-1-YL)PHENYL-ACETAMIDE AND CORRESPONDING PIPERIDINE  
DERIVATIVES AS FACTOR XA INHIBITORS FOR THE TREATMENT OF THROMBO-EMBOLIC DISEASES

(54) Bezeichnung: N-'4-(2-IMINO-PYRROLIDIN-1-YL)PHENYL-ACETAMID-UND ENTSPRECHENDE PIPERIDINDERI-  
VATE ALS FAKTOR XA INHIBITOREN ZUR BEHANDLUNG VON THROMBOEMBOLISCHEN ERKRANKUNGEN



(57) Abstract: The invention relates to novel compounds of formula (I)  
wherein D, M, W, X, Y, T and R<sup>1</sup> have the designation cited in patent  
claim 1. According to the invention, said compounds are inhibitors of the  
coagulation factor Xa and can be used for the prophylaxis and/or treatment  
of thromboembolic diseases and for the treatment of tumours.

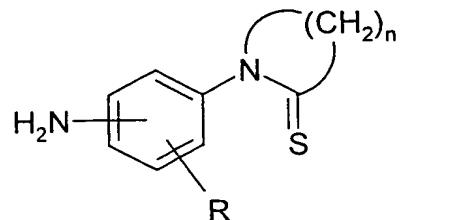
(57) Zusammenfassung: Neue Verbindungen der Formel (I), worin D, M, W,  
X, Y, T und R<sup>1</sup> die in Patentanspruch 1 angegebene Bedeutung haben, sind  
Inhibitoren des Koagulationsfaktors Xa und können zur Prophylaxe und/oder  
Therapie von thromboembolischen Erkrankungen und zur Behandlung von Tu-

moren eingesetzt werden.

**Abstract**

Novel compounds of the formula I

5



VI

10

in which

D, M, W, X, Y, T and R<sup>1</sup> are as defined in Patent Claim 1,

15

are inhibitors of coagulation factor Xa and can be employed for the prophylaxis and/or therapy of thromboembolic diseases and for the treatment of tumours.

20

25

30

35